?



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 8. Januar 2004 (08.01.2004)

**PCT** 

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 2004/002477 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 31/4155. 31/4178, 31/433, 31/42, C07D 403/12, 417/12, 413/14, 403/14
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/005898
- (22) Internationales Anmeldedatum:

5. Juni 2003 (05.06.2003)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

- (30) Angaben zur Priorität: 102 29 070.9 28. Juni 2002 (28.06.2002) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): CEZANNE, Bertram [DE/DE]; Bahnstrasse 74, 64546 Mörfelden-Walldorf (DE). DORSCH, Dieter [DE/DE]; Königsberger Strasse 17A, 64372 Ober-Ramstadt (DE). MEDERSKI, Werner [DE/DE]; Katzenellnbogenweg 1, 64673 Zwingenberg (DE). TSAKLAKIDIS, Christos [GR/DE]; Im Langgewann 54, 69469 Weinheim (DE). GLEITZ, Johannes [DE/DE]; Liebigstrasse 26, 64293 Darmstadt (DE). BARNES, Christopher [GB/DE]; Sperberstrasse 109A, 65812 Bad Soden (DE).

- (74) Anwalt: MERCK PATENT GMBH; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

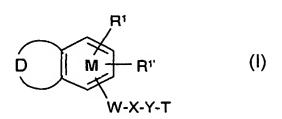
## Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- (48) Datum der Veröffentlichung dieser berichtigten Fassung: 15. April 2004
- (15) Informationen zur Berichtigung: siehe PCT Gazette Nr. 16/2004 vom 15. April 2004, Section II

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: 2-(PHENYL)-2H-PYRAZOLE-3-CARBOXYLIC ACID-N-4-(THIOXO-HETEROCYCLYL)-PHENYL-AMIDE DERIVATIVES AND CORRESPONDING IMINO-HETEROCYCLYL DERIVATIVES AND RELATES COMPOUNDS FOR USE AS INHIBITORS OF THE COAGULATION FACTORS XA AND/OR VIIA FOR TREATING THROMBOSES

(54) Bezeichnung: 2-(PHENYL)-2H-PYRAZOL-3-CARBONSÄURE-N-4-(THIOXO-HETEROCYCLYL)-PHENYL-AMID DERIVATE UND ENTSPRECHENDE IMINO-HETEROCYCLYL DERIVATE SOWIE VERWANDTE VERBINDUNGEN ALS INHIBITOREN DER KOAGULATIONSFAKTOREN XA UND/ODER VIIA ZUR BEHANDLUNG BON THROMBOSEN



- (57) Abstract: The invention relates to the novel compounds of formula (I), wherein D, M, W, X, Y, T, R<sup>1</sup> and R<sup>1</sup> are defined as in patent claim 1. The inventive compounds are inhibitors of coagulation factor Xa and can be used in the prophylaxis and/or therapy of thromboembolic diseases and in the treatment of tumors.
- (57) Zusammenfassung: Neue Verbindungen der Formel (I) worin D, M, W, X, Y, T, R1 und

R¹ die in Patentanspruch 1 angegebene Bedeutung haben, sind Inhibitoren des Koagulationsfaktors Xa und können zur Prophylaxe und/oder Therapie von thromboembolischen Erkrankungen und zur Behandlung von Tumoren eingesetzt werden.